

US 4713389

04579174

WPI Acc No: 1986-082518/198613

New N-acyl-carbamoyl-saccharin derivs. - with fungicidal and bactericidal activity prep'd. by reaction of saccharin with acyl isocyanate(s) or isothiocyanate(s)

Patent Assignee: BAYER AG (FARB)

Inventor: BRANDES W; FUHRER W; HAGEMANN H; HAJEK M; HANSSLER G; KUHLE E; REINECKE P; SALZBURG H

Number of Countries: 020 Number of Patents: 014

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
DE 3433391	A	19860320	DE 3433391	A	19840912	198613 B
EP 177740	A	19860416	EP 85110995	A	19850831	198616
AU 8547384	A	19860320			198619	
JP 61068477	A	19860408	JP 85199614	A	19850911	198620
ZA 8506951	A	19860311	ZA 856951	A	19850911	198623
DK 8504133	A	19860313			198629	
BR 8504387	A	19860708			198634	
PT 81081	A	19860916			198644	
ES 8605496	A	19860901	ES 546877	A	19850911	198646
HU 39966	T	19861128			198701	
DD 239516	A	19861001			198705	
US 4713389	A	19871215	US 85774271	A	19850910	198806
EP 177740	B	19880928			198839	
DE 3565261	G	19881103			198845	

Priority Applications (No Type Date): DE 3433391 A 19840912

Cited Patents: FR 2507599; GB 1278111; US 3264314

Abstract (Basic): DE 3433391 A

N-(N-Acyl-carbamoyl)saccharin derivs. of formula (I) are new: X = O or S; R = -CO-R1 or -SO₂-OR2; R1 = alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, cycloalkoxy, NR₃R₄, or opt. mono- or polysubstd. aryl, aryloxy or arylthio; R2 = alkyl or phenyl; R3 = alkyl; R4 = alkyl, phenyl, haloalkylthio, alkoxy carbonyl or phenoxy carbonyl; or NR₃R₄ = saccharin residue.

USE - The cpds. have pesticidal activity, esp. against fungi and bacteria. The cpds. are well tolerated by plants, and are suitable for use against e.g. phytophthora infestans on tomatoes, Pyrenophora teres, Septoria nodorum, Fusarium culmorum and Drechslera graminea on cereals, and Pyricularia oryzae on rice. ((35pp Dwg.No.0/1)

Abstract (Equivalent): EP 177740 B

Acylated saccharin derivatives of the general formula (I), in which X represents oxygen or sulphur and R represents the grouping -CO-R1 or -SO₂-OR2, wherein R1 represents straight-chain or branched alkyl with 1

BEST AVAILABLE COPY

to 4 carbon atoms, or represents straight-chain or branched halogenoalkyl or halogenoalkoxy with in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 5 identical or different halogen atoms, or represents straight-chain or branched alkoxy or alkylthio with in each case 1 to 10 carbon atoms, or represents aryl, aryloxy or arylthio with in each case 6 to 10 carbon atoms, each of which is optionally mono-, di-, tri-, tetra- or penta-substituted by identical or different substituents, substituents of the aryl which may be mentioned being: halogen, straight-chain or branched alkoxy with 1 to 4 carbon atoms, alkoxy carbonyl with 1 to 4 carbon atoms in the alkoxy part, straight-chain or branched alkyl with 1 to 4 carbon atoms and N-halogenoalkyl-N-halogenoalkylthioamine with 1 to 3 carbon atoms and 1 to 5 identical or different halogen atoms per halogenoalkyl radical; or furthermore represents cycloalkoxy with 3 to 6 carbon atoms or represents the group -NR₃R₄. R₂ represents straight-chain or branched alkyl with 1 to 4 carbon atoms or phenyl, R₃ represents straight-chain or branched alkyl with 1 to 8 carbon atoms and R₄ represents straight-chain or branched alkyl with 1 to 4 carbon atoms, phenyl, halogenoalkylthio with 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 identical or different halogen atoms, alkoxy carbonyl with 1 to 4 carbon atoms, in the alkoxy part or phenoxy carbonyl, or R₃ and R₄, together with the nitrogen atom on which they stand, form a saccharin radical. (15pp)

Abstract (Equivalent): US 4713389 A

An acylated saccharin has formula (1), where X is O or S; R is (a) 1-6C (halo)alkyl or haloalkoxy contg. 1-5 halogen, 1-10C alkylthio; (b) 6-10C aryl or aryloxy or arylthio opt. subst. 1-5 times by halogen, 1-4 alkoxy or alkoxy carbonyl and/or 1-3C N-haloalkyl-N-haloalkylthioamine contg. 1-5 halogen per haloalkyl radical, (c) 3-6C cycloalkyl or -NQQ'; Q is 1-8C alkyl; Q' is 1-4C alkyl or haloalkylthio, Ph, (1-4C) alkoxy carbonyl or phenoxy carbonyl; -NQQ' can be a saccharin radical.

A pref. cpd. (1) is e.g.

N-(1,3-Cl₂-isopropyl-2-oxycarbonyl-aminocarbonyl)-saccharin,
N-(n-butoxycarbonyl aminocarbonyl)-saccharin.

USE/ADVANTAGE - For the treatment of above ground parts of plants, vegetative stocks, seeds and soil; cpd. (1) is well tolerated by plants at the treatment levels. (8pp)

Derwent Class: C02

THIS PAGE BLANK (USPTO)



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

⑪ Veröffentlichungsnummer:

O 177 740
A1

⑫

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

⑬ Anmeldenummer: 85110995.9

⑮ Int. Cl.: C07 D 275/06, A 01 N 47/38

⑭ Anmeldetag: 31.08.85

⑯ Priorität: 12.09.84 DE 3433391

⑰ Anmelder: BAYER AG, Konzernverwaltung RP
Patentabteilung, D-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk (DE)

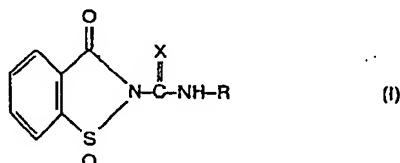
⑳ Veröffentlichungstag der Anmeldung: 16.04.86
Patentblatt 86/16

⑲ Erfinder: Salzburg, Herbert, Dr., Hahnenweg 3,
D-5000 Köln 80 (DE)
Erfinder: Hajek, Manfred, Dr., Hahnenweg 1,
D-5000 Köln 80 (DE)
Erfinder: Hagemann, Hermann, Dr.,
Kandinskystrasse 52, D-5090 Leverkusen 1 (DE)
Erfinder: Kühle, Engelbert, Dr.,
von-Bodelschwingh-Strasse 42,
D-5060 Bergisch Gladbach 2 (DE)
Erfinder: Führer, Wolfgang, Dr., Wehrstrasse 28,
D-5202 Hennef 1 (DE)
Erfinder: Hänsler, Gerd, Dr., Am Arenzberg 58a,
D-5090 Leverkusen 3 (DE)
Erfinder: Brandes, Wilhelm, Dr., Eichendorffstrasse 3,
D-5653 Leichlingen 1 (DE)
Erfinder: Reinecke, Paul, Dr., Steinstrasse 8,
D-5090 Leverkusen 3 (DE)

㉑ Benannte Vertragsstaaten: AT BE CH DE FR GB IT LI NL
SE

㉒ Acylierte Saccharin-Derivate.

㉓ Acylierte Sacharin-Derivate der allgemeinen Formel (I)



sowie ihre Verwendung in Schädlingsbekämpfungsmitteln,
vor allem als Fungizide und Bakterizide.

Die neuen acylierten Saccharin-Derivate können z.B.
hergestellt werden, indem man Saccharin mit geeigneten
Iso- bzw. Thioisocyanatderivaten gegebenenfalls in Gegen-
wart von Katalysatoren und in Gegenwart von Verdün-
nungsmitteln umsetzt.

EP 0 177 740 A1

in welcher

X für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R für die Gruppierung $-CO-R^1$ oder $-SO_2-OR^2$ steht,

wobei

R¹ für Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, jeweils gegebenenfalls ein- bis mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryloxy oder Arylthio steht, ferner für Cycloalkoxy oder für die Gruppe $-NR^3R^4$ steht,

R² für Alkyl oder Phenyl steht,

R³ für Alkyl steht,

R⁴ für Alkyl, Phenyl, Halogenalkylthio, Alkoxy carbonyl oder Phenoxy carbonyl steht oder

R³ und R⁴ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an dem sie stehen, einen Saccharinrest bilden,

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT
Konzernverwaltung RP
Patentabteilung

5090 Leverkusen, Bayerwerk
Bas/ABC 1. 1. A
Ia

Acylierte Saccharin-Derivate

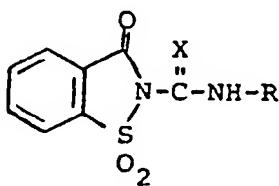
Die Erfindung betrifft neue acylierte Saccharin-Derivate, ein Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung in Schädlingsbekämpfungsmitteln.

Es ist bereits bekannt, daß Alkylaminocarbonyl-saccharin-
5 Derivate, z.B. das N-/Methylaminocarbonyl-saccharin,
eine fungizide Wirksamkeit aufweisen (vgl. z.B. DE-OS
1 953 422). Weiterhin sind halogenierte Phenylamino-
carbonyl-saccharin-Derivate, wie z.B. das N-/3,4-Di-
chlorphenylaminocarbonyl-saccharin, bekannt und ihre bak-
10 terizide und fungizide Wirkung (vgl. US-PS 3 264 314).

Weiterhin sind 3-Alkenyloxy-isosaccharin-Derivate und
ihre fungizide Wirksamkeit bekannt (vgl. JP-70 14 301).

Es wurden neue acylierte Saccharin-Derivate der allge-
meinen Formel (I)

15



(I)

Le A 23 286 Ausland

in welcher

X für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R für die Gruppierung $-CO-R^1$ oder $-SO_2-OR^2$ steht,
wobei

5 R¹ für Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy,
Alkylthio, jeweils gegebenenfalls ein- bis mehr-
fach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl,
Aryloxy oder Arylthio steht, ferner für Cycloalkoxy
oder für die Gruppe $-NR^3R^4$ steht,

10 R² für Alkyl oder Phenyl steht,

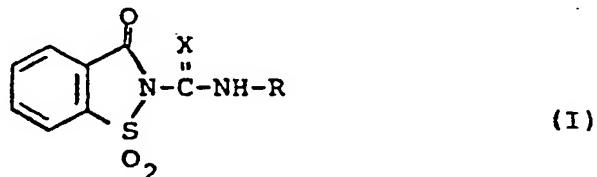
R³ für Alkyl steht,

R⁴ für Alkyl, Phenyl, Halogenalkylthio, Alkoxycarbo-
nyl oder Phenoxy carbonyl steht oder

15 R³ und R⁴ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an dem sie
stehen, einen Saccharinrest bilden,

gefunden.

Weiterhin wurde gefunden, daß man die neuen acylierten
Saccharin-Derivate der allgemeinen Formel (I)



Le A 23 286 Ausland

in welcher

X für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R für die Gruppierung $-CO-R^1$ oder $-SO_2-OR^2$ steht,
wobei

5 R¹ für Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy,
Alkylthio, jeweils gegebenenfalls ein- bis mehr-
fach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl,
Aryloxy oder Arylthio steht, ferner für Cycloalkoxy
oder für die Gruppe $-NR^3R^4$ steht,

10 R² für Alkyl oder Phenyl steht,

R³ für Alkyl steht,

R⁴ für Alkyl, Phenyl, Halogenalkylthio, Alkoxycarbo-
nyl oder Phenoxy carbonyl steht oder

15 R³ und R⁴ gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an dem sie
stehen, einen Saccharinrest bilden,

erhält, wenn man Saccharin der Formel (II)



mit Iso- bzw. Thioisocyanat-Derivaten der Formel (III)

Le A 23 286 Ausland

XCN-R

(III)

in welcher

X und R die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Lösungs- oder Ver-
5 dünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines
Katalysators umsetzt.

Schließlich wurde gefunden, daß die neuen acylierten
Saccharin-Derivate eine gute Wirkung gegen Schädlinge
besitzen, vor allem gegen Pilze und Bakterien.

10 Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäßen acyliert-
ten Saccharin-Derivate der Formel (I) eine höhere bio-
logische Wirksamkeit als die aus dem Stand der Technik
vorbekannten Verbindungen der gleichen Wirkungsrichtung.
Die erfindungsgemäßen Verbindungen stellen somit eine Be-
15 reicherung der Technik dar.

Die erfindungsgemäßen acylierten Saccharin-Derivate
sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugt
sind Verbindungen der Formel (I), bei welchen

X für Sauerstoff oder Schwefel steht,

20 R für die Gruppierung $-CO-R^1$ oder $-SO_2-OR^2$ steht,
wobei R^1 für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bisLe A 23 286 Ausland

4 Kohlenstoffatomen, für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 6, insbesondere 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5, insbesondere 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, für geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls 1- bis 5-fach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryloxy oder Arylthio mit jeweils 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, wobei als Substituenten des Aryls genannt seien: Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und N-Halogenalkyl-N-halogenalkylthioamino mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen je Halogenalkylrest; ferner für Cycloalkoxy mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für die Gruppe $-NR^3R^4$ steht,

R^2 für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl steht,

R^3 für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen steht und

R^4 für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Halogenalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, Alkoxycarbonyl mit 1

Le A 23 286 Ausland

bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil oder Phenoxy-carbonyl steht oder

R^3 und R^4 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an dem sie stehen, einen Saccharinrest bilden.

5 Besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), bei welchen

X für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R für die Gruppierung $-CO-R^1$ oder $-SO_2-OR^2$ steht, wobei

10 R^1 für Methyl, Ethyl, für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Fluor- und Chloratomen, für geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, für geradkettiges oder verzweigtes Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls ein- bis dreifach, gleich oder verschieden durch Chlor, Fluor, Methoxy, Ethoxy, Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl und N-Trifluormethyl-N-fluordichlormethylthio-amino substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio, für Cyclohexoxy oder für die Gruppe $-NR^3R^4$ steht,

R^2 für Methyl, Ethyl oder Phenyl steht,

Le A 23 286 Ausland

R³ für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,

R⁴ für Methyl, Ethyl, Phenyl, Phenoxy carbonyl, Methoxy carbonyl, Ethoxy carbonyl oder Halogen alkylthio mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Fluor- und Chloratomen steht oder

R³ und R⁴ mit dem Stickstoffatom, an dem sie stehen, einen Saccharinrest bilden.

Ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel
10 (I), bei welchen

X für Sauerstoff steht,

R für die Gruppierung -CO-R¹ steht, wobei

R¹ für Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy, n-Butoxy, iso-Butoxy, tert.-Butoxy, Pentoxy, Hexoxy, 15 2-n-Butyl-butoxy, Chlormethoxy, 2,2,2-Tri-fluorethoxy, 1-Chlormethyl-2-chlorethoxy, Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, iso-Propylthio, Phenoxy, Phenylthio, Cyclohexoxy, 2-Methoxy-phenoxy, 4-Methoxy-phenoxy, 2-Chlor-phenoxy, 4-Chlor-phenoxy, 2,4-Dichlorphenoxy, 2-Methoxycarbonyl-phenoxy, 2-Chlorphenylthio, 4-Chlorphenylthio, N-Methyl-N-phenylamino, N-Ethyl-N-phenylamino, N-n-Propyl-N-phenyl-amino, N-n-Butyl-N-phenyl-amino, N-n-Butyl-N-trichlormethylthio-amino, N-

Le A 23' 286 Ausland

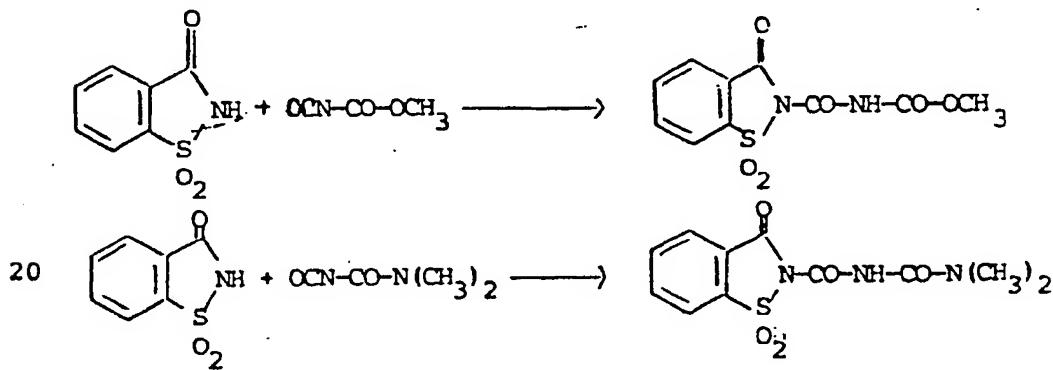
Methyl-N-phenoxy carbonyl-amino, N-Ethyl-N-phenoxy carbonyl-amino, N-n-Propyl-N-phenoxy-carbonyl-amino, N-Methyl-N-methoxy-carbonyl-amino, N-Ethyl-N-ethoxy-carbonyl-amino, N-n-Butyl-N-phenoxy-carbonyl-amino,
 5 N-iso-Butyl-N-phenoxy-carbonyl-amino, N-iso-Pentyl-N-phenoxy-carbonyl-amino, 2-/N-Trifluormethyl-N-dichlor-fluormethylthio-amino-phenyl, 3-/N-Trifluor-methyl-N-dichlorfluormethylthio-amino-phenyl,
 10 4-/N-Trifluormethyl-N-dichlorfluormethylthio-amino-phenyl oder 1,1-Dioxid-3-keto-2H,3H-1,2-benzisothia-zolyl steht oder

X für Sauerstoff steht,

R für die Gruppierung $-SO_2-OR^2$ steht, wobei

R^2 für Phenyl, Methyl oder Ethyl steht.

15 Verwendet man beispielsweise Saccharin und Methoxy-carbonylisocyanat bzw. Dimethylaminocarbonylisocyanat als Ausgangsmaterialien, so lassen sich die Reaktions-abläufe durch die folgenden Formelschemata wiedergeben:



Le A 23 286 Ausland

Das zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens, als Ausgangsstoff benötigte Saccharin der Formel (II) ist bekannt und käuflich auch in technischem Maßstab zu erwerben.

- 5 Die weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Iso- bzw. Thioisocyanat-Derivate der Formel (III) sind ebenfalls bekannt und nach literaturbekannten Verfahren herstellbar. Allgemeine Vorschriften sind in Standardwerken wie Houben-Weyl "Methoden der Organischen Chemie" E 4, 1983, Thieme-Verlag Stuttgart beschrieben, Verbindungen, in denen R für z.B. Alkylcarbonyl steht, können hergestellt werden wie beschrieben in "J. Org. Chem." 27, 3742ff (1962) und 28, 1805ff (1962), außerdem "Angewandte Chemie" 89, 789 (1977). Verbindungen in denen R für
- 10 15 z.B. Alkoxy carbonyl steht, können nach den Beschreibungen in "Berichte der Deutschen Chem. Ges." 39, 688ff (1906) hergestellt werden.

Als Verdünnungsmittel kommen für das Verfahren alle inerten organischen Lösungsmittel in Frage. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylool, Petrolether, Pentan, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff oder Chlorbenzol; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Ethylenglycoldimethyl-ether, Dioxan oder Tetrahydrofuran; Ketone, wie Aceton oder Butanon; Nitrile, wie Acetonitril oder Propionitril, Ester von Carbonsäuren, wie Essigsäureethyl-

Le A 23 286 Ausland

ester, Essigsäurebutylester oder Propionsäureethylester.

Das erfindungsgemäße Verfahren kann auch in Abwesenheit eines Verdünnungs- oder Lösungsmittels durchgeführt werden. In diesem Fall setzt man vorzugsweise die Acylie-

- 5 rungskomponente in einem Überschuß von 0,1 bis 5 Äquivalenten ein. Nach Reaktionsbeendigung wird das überschüssige Reagenz im Vakuum abdestilliert.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Be-

- 10 reich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen 0°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 25°C und 60°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren wird vorzugsweise bei Normaldruck durchgeführt.

- 15 Als Katalysatoren werden die für Isocyanat-Additionen üblichen Katalysatoren, wie z.B. Dibutylzinndilaurat, Triethylamin und Triethylendiamin (DABCO), eingesetzt.

- 20 Eine Variante der Reaktion besteht darin, daß anstelle der Alkoxy carbonylisocyanate ein Alkoxy carbonylaminocarbonylhalogenid, vorzugsweise -chlorid, eingesetzt werden kann. Zweckmäßigerweise setzt man auch hier ungefähr ein Äquivalent einer Hilfsbase wie Triethylamin oder Pyridin, Natriumhydrogencarbonat oder Natriumcarbonat zu.

Le A 23 286 Ausland

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen praktisch eingesetzt werden. Die Wirkstoffe sind für den Gebrauch als Schädlingsbekämpfungsmittel geeignet.

5 So werden z.B. fungizide Mittel im Pflanzenschutz eingesetzt zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomyces, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes.

10 Bakterizide Mittel werden z.B. im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae eingesetzt.

15 Beispielhaft, aber nicht begrenzend, seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;
Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
- 20 Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
Podosphaera-Arten wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;
Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
- 25 Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;

Le A 23 286 Ausland

- Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas oryzae*;
Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas lachrymans*;
- 5 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;
Pyrenophora-Arten; wie beispielsweise *Pyrenophora teres*;
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- 10 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*) und
Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den
15 zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Kon-
zentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen
Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Als Schädlingsbekämpfungsmittel können die erfindungs-
gemäßen Wirkstoffe mit besonders guten Erfolg zur Be-
20 kämpfung von Obst- und Gemüsekrankheiten, wie beispiels-
weise gegen den Erreger der Braunfäule (*Phytophthora in-*
festans) an Tomaten, außerdem zur Bekämpfung von Ge-
treidekrankheiten, zum Beispiel verursacht durch
Pyrenophora teres, *Septoria nodorum*, *Fusarium culmorum*
25 und *Drechslera graminea*, weiterhin zur Bekämpfung von
Reiskrankheiten, wie beispielsweise den Erreger der
Blattfleckenkrankheit (*Pyricularia oryzae*) eingesetzt
werden. Die Verbindungen weisen auch eine bakterizide
Wirkung auf.

Le A 23 286 Ausland

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder Schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylen oder Methylchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfaktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethyleketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie

Le A 23 286 Ausland

- Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnusschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycol-ether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.
- Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.
- Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalo-

Le A 23-286 Ausland

cyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1
5 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in den Formulierungen in Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen vorliegen, wie Fungizide, Insektizide, Akarizide und
10 Herbizide, sowie in Mischungen mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, emulgierbare Konzentrate,
15 Emulsionen, Schäume, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate, angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner
20 möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren.
Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Bei der Behandlung von Pflanzenteilen können die Wirkstoffkonzentrationen in den Anwendungsformen in einem größeren Bereich variiert werden. Sie liegen im allgemeinen zwischen 1 und 0,0001 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 0,001 %.

Le A 23 286 Ausland

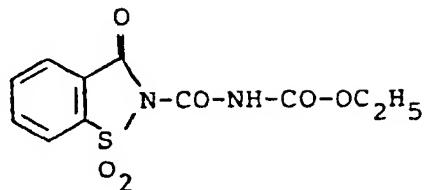
0177740

- 16 -

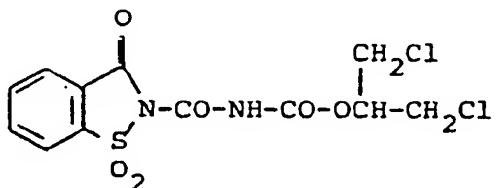
Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 50 g je Kilogramm Saatgut, vorzugsweise 0,01 bis 10 g, benötigt.

Bei Behandlung des Bodens sind Wirkstoffkonzentrationen
5 von 0,00001 bis 0,1 Gew.-%, vorzugsweise von 0,0001 bis 0,02 %, am Wirkungsort erforderlich.

Le A 23 286 Ausland

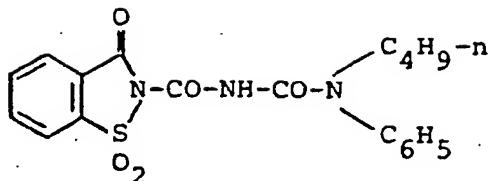
HerstellungsbeispieleBeispiel 1

17,3 g (0,095 Mol) Saccharin werden in 250 ml Aceton
 5 mit 0,2 ml Triethylamin und anschließend unter Zutropfen
 mit 11,5 g (0,1 Mol) Ethoxycarbonylisocyanat versetzt.
 Nach 1 h Rühren bei 45°C ist die Umsetzung beendet. Ein-
 engen im Vakuum liefert 28,2 g (99 % der Theorie) an
 N-(Ethoxycarbonylaminocarbonyl)-saccharin vom Schmp.
 10 148°C.

Beispiel 2

Analog Beispiel 1 erhält man aus 17,3 g Saccharin und
 19,7 g (0,1 Mol) 1,3-Dichlor-isopropyl-2-oxycarbonyl-
 15 isocyanat in 200 ml Methylenchlorid 36,0 g (99 % der
 Theorie) an N-(1,3-Dichlorisopropyl-2-oxycarbonylaminocarbonyl)-saccharin mit einem Schmelzpunkt von 208°C.

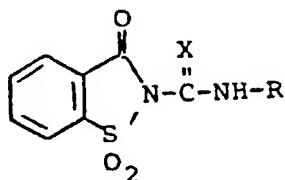
Le A 23 286 Ausland

Beispiel 3

9,2 g Saccharin (0,05 Mol) werden in 100 ml Dioxan mit
0,1 g Triethylendiamin (DABCO) gelöst und anschließend
5 10,9 g (0,05 Mol) Bütylphenylaminocarbonylisocyanat zuge-
geben. Das Gemisch wird unter Feuchtigkeitsausschluß
6 h am Rückfluß gekocht, anschließend eingeengt und der
Rückstand dreimal mit Diisopropylether verrührt. Man er-
hält 6 g (30 % der Theorie) an n-Butyl-phenylamino-
10 carbonylaminocarbonylsaccharin mit dem Schmelzpunkt
von 210°C.

Le A 23 286 Ausland

In entsprechender Weise gemäß den allgemeinen Herstellungsangaben werden die folgenden Verbindungen der Formel (I) hergestellt:

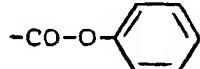
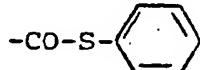
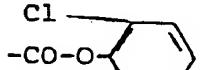
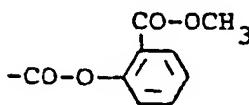


(I)

Beispiel- Nr.	X	R	Physikalische Konstanten /Schmp: °C/
4	O	-CO-OCH ₂ -CH(CH ₃) ₂	146
5	O	-CO-OCH ₂ -CF ₃	181
6	O	-CO-SC ₃ H ₇ -n	179
7	O	-CO-OCH ₂ -CH-CH ₂ -CH ₃ (CH ₂) ₃ -CH ₃	81
8	O	-CO-O-	112
9	S	-CO-OC ₂ H ₅	243
10	O	-CO-S-	180
11	O	-CO-OCH ₂ Cl	167

Le A 23 286 Ausland

Fortsetzung

Beispiel- Nr.	X	R	Physikalische Konstanten [Schmp: °C]
12	O	-CO-OC ₆ H ₁₁	118
13	O	-CO-O-  -OCH ₃	81
14	O	-CO-OC ₄ H _{9-n}	224
15	O	-CO-N / \ SCl ₃ C ₄ H _{9-n}	81
16	O	-CO-S-  -Cl	81
17	O	-CO-N / \ CH ₃ C-O-C ₆ H ₅ O	190
18	O	-CO-N / \ CH ₂ -C(CH ₃) ₃ C-O-C ₆ H ₅	81
19	O	-CO-O- 	194
20	O	-CO-O- 	175
21	O	-CO-N / \ O S O ₂ O	265

Le A 23 286 Ausland

0177740

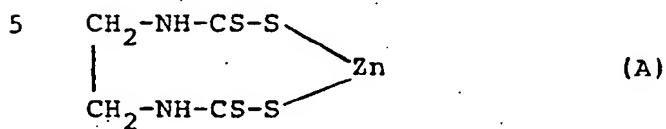
- 21 -

Beispiel- Nr.	X	R	Physikalische Konstanten /Schmp: °C/
22	S	-CO-OC ₆ H ₅	210
23	O	-SO ₂ -O-C ₆ H ₅	161
24	O		98
25			198
26	O		81

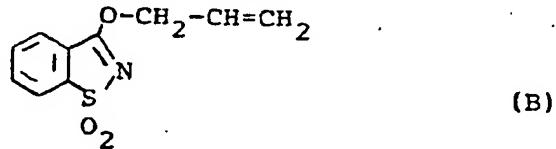
Le A 23 286 Ausland

Anwendungsbeispiele

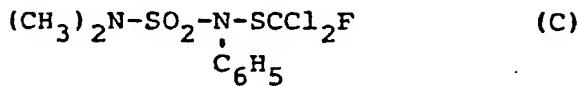
In den folgenden Anwendungsbeispielen werden die nachfolgend aufgeführten Verbindungen als Vergleichssubstanzen eingesetzt:



Zinkethylen-1,2-bis-dithiocarbamat



3-Allyloxy-1,2-benzisothiazol-1,1-dioxid



10 N,N-Dimethyl-N'-phenyl-N'-dichlorfluor-methylthio-sulfamid

Le A 23 286 Ausland

Beispiel A**Pyricularia-Test (Reis) /protektiv**

Lösungsmittel: 12,5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

- 5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser und der angegebenen Menge Emulgator auf die gewünschte Konzentration.
- 10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Reispflanzen mit der Wirkstoffzubereitung bis zur Tropfnässe. Nach dem Abtrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von Pyricularia oryzae inkuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 100 % rel. Luftfeuchtigkeit und 25°C aufgestellt.
- 15 4 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung des Krankheitsbefalls.
- 20 Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test z.B. die Verbindungen gemäß den Herstellungsbeispielen: 2, 14, 8, 5, 23, 10, 1, 13, 16, 15 und 24.

Le. A 23 286 Außland

Beispiel B

Pyricularia-Test (Reis) / systemisch

Lösungsmittel: 12,5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykol-
5 ether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser und der angegebenen Menge Emulgator auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf systemische Eigenschaften werden 40 ml der Wirkstoffzubereitung auf Einheitserde gegossen, in der junge Reispflanzen angezogen wurden. 7 Tage nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von Pyricularia oryzae inkokuliert. 15 Danach verbleiben die Pflanzen in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von 25°C und einer rel. Luftfeuchtigkeit von 100 % bis zur Auswertung.

20 4 Tage nach der Inkokulation erfolgt die Auswertung des Krankheitsbefalls.

Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test z.B. die Verbindungen gemäß den Herstellungsbeispielen:
2, 14, 8, 5, 4, 23, 10, 11, 13, 16, 15 und 26.

Le A 23 286 Ausland

Beispiel C

Phytophthora-Test (Tomate) /protektiv

Lösungsmittel: 4,7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 0,3 Gewichtsteile Alkyl-aryl-polyglykol-
ether

5

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung bis zur Tropfnässe. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von Phytophthora infestans inkuliert.
- 15 Die Pflanzen werden in einer Inkubationskabine mit 100 % relativer Luftfeuchtigkeit und ca. 20°C aufgestellt.

3 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung.

- Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test z.B.
- 20 die Verbindungen gemäß den Herstellungsbeispielen:
25 und 24.

Le A 23 286 Ausland

Beispiel D

Pyrenophora teres-Test (Gerste) / protektiv

Lösungsmittel: 100 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 0,25 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykol-
5 ether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit besprüht man junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung taufeucht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension von Pyrenophora teres besprüht.

15 Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100% rel. Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 80 % aufgestellt.

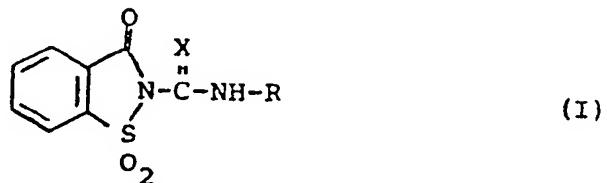
20 7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung.

Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik zeigt bei diesem Test z.B. die Verbindung gemäß dem Herstellungsbeispiel: 24.

Le A 23 286 Ausland

Patentansprüche

1. Acylierte Saccharin-Derivate der allgemeinen Formel (I)



5 in welcher

X für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R für die Gruppierung $-CO-R^1$ oder $-SO_2-OR^2$
steht, wobei

10 R^1 für Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy,
Alkylthio, jeweils gegebenenfalls ein- bis
mehrfach, gleich oder verschieden substitu-
iertes Aryl, Aryloxy oder Arylthio steht,
ferner für Cycloalkoxy oder für die Gruppe
 $-NR^3R^4$ steht,

15 R^2 für Alkyl oder Phenyl steht,

R^3 für Alkyl steht,

R^4 für Alkyl, Phenyl, Halogenalkylthio,
Alkoxycarbonyl oder Phenoxy carbonyl steht oder

Le A 23 286 Ausland

R^3 und R^4 gemeinsam mit dem Stickstoffatom an dem sie stehen, einen Saccharinrest bilden.

2. Acylierte Saccharin-Derivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

- 5 X für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- R für die Gruppierung $-CO-R^1$ oder $-SO_2-OR^2$ steht, wobei
- 10 R^1 für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, für geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls 1- bis 5-fach, gleich oder verschiedenen substituiertes Aryl, Aryloxy oder Arylthio mit jeweils 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, wobei als Substituenten des Aryls genannt seien: Halogen, geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil, geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und N-Halogenalkyl-N-halogenalkylthioamin mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halo-
- 15
- 20
- 25

Le A 23 286 Ausland

genatomen je Halogenalkylrest; ferner für Cycloalkoxy mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für die Gruppe $-NR^3R^4$ steht,

- R^2 für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Phenyl steht,
 - 5 R^3 für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen steht und
 - 10 R^4 für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Phenyl, Halogenalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkoxyteil oder Phenoxy carbonyl steht oder
 - 15 R^3 und R^4 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an dem sie stehen, einen Saccharinrest bilden.
3. Acylierte Saccharin-Derivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
- X für Sauerstoff oder Schwefel steht,
 - 20 R für die Gruppierung $-CO-R^1$ oder $-SO_2-OR^2$ steht, wobei

Le A 23 286 Ausland

- R¹ für Methyl, Ethyl, für geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl oder Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Fluor- und Chloratomen, für geradkettiges oder verzweigtes Alkoxy mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, für geradkettiges oder verzweigtes Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls ein- bis dreifach, gleich oder verschieden durch Chlor, Fluor, Methoxy, Ethoxy, Methyl, Ethyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl und N-Trifluormethyl-N-fluordichlormethylthioamin substituiertes Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio, für Cyclohexoxy oder für die Gruppe -NR³R⁴ steht,
- R² für Methyl, Ethyl oder Phenyl steht,
- R³ für geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen steht,
- R⁴ für Methyl, Ethyl, Phenyl, Phenoxy carbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl oder Halogenalkylthio mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 gleichen oder verschiedenen Fluor- und Chloratomen steht oder
- R³ und R⁴ mit dem Stickstoffatom, an dem sie stehen, einen Saccharinrest bilden.
4. Acylierte Saccharin-Derivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

Le A 23 286 Ausland

X für Sauerstoff steht,
R für die Gruppierung $-CO-R^1$ steht, wobei
 R^1 für Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, iso-Propoxy,
n-Butoxy, iso-Butoxy, tert.-Butoxy, Pentoxy,
Hexoxy, 2-n-Butyl-butoxy, Chlormethoxy,
5 2,2,2-Trifluorethoxy, 1-Chlormethyl-2-chlor-
ethoxy, Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio,
iso-Propylthio, Phenoxy, Phenylthio, Cyclo-
hexoxy, 2-Methoxy-phenoxy, 4-Methoxy-phenoxy,
10 2-Chlor-phenoxy, 4-Chlorphenoxy, 2,4-Dichlor-
phenoxy, 2-Methoxycarbonyl-phenoxy, 2-Chlor-
phenylthio, 4-Chlorphenylthio, N-Methyl-N-
phenylamino, N-Ethyl-N-phenylamino, N-n-Propyl-
N-phenyl-amino, N-n-Butyl-N-phenyl-amino, N-n-
15 Butyl-N-trichlormethylthio-amino, N-Methyl-
N-phenoxy carbonyl-amino, N-Ethyl-N-phenoxy-
carbonyl-amino, N-n-Propyl-N-phenoxy-carbonyl-
amino, N-Methyl-N-methoxy-carbonyl-amino, N-
Ethyl-N-ethoxy-carbonyl-amino, N-n-Butyl-N-
20 phenoxy-carbonyl-amino, N-iso-Butyl-N-phe-
noxy-carbonyl-amino, N-iso-Pentyl-N-phenoxy-
carbonyl-amino, 2-/ \bar{N} -Trifluormethyl-N-di-
chlor-fluormethylthio-amino $_7$ -phenyl, 3-/ \bar{N} -
25 Trifluormethyl-N-dichlorfluormethylthio-amino $_7$ -
phenyl, 4-/ \bar{N} -Trifluormethyl-N-dichlorfluor-
methylthio-amino $_7$ -phenyl oder 1,1-Dioxid-
3-keto-2H, 3H-1,2-benzisothiazolyl steht, oder

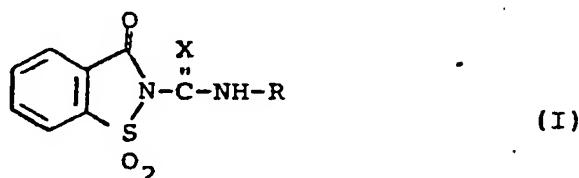
Le A 23 286 Ausland

X für Sauerstoff steht,

R für die Gruppierung $-SO_2-OR^2$ steht, wobei

R^2 für Phenyl, Methyl oder Ethyl steht.

5. Verfahren zur Herstellung von acylierten Saccharin-Derivaten der allgemeinen Formel (I)



in welcher

X für Sauerstoff oder Schwefel steht,

- 10 R für die Gruppierung $-CO-R^1$ oder $-SO_2-OR^2$ steht, wobei

15 R¹ für Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, jeweils gegebenenfalls ein- bis mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryloxy oder Arylthio, ferner für Cycloalkoxy oder für die Gruppe $-NR^3R^4$ steht,

R² für Alkyl oder Phenyl steht,

Le A 23 286 Ausland

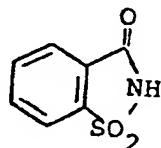
- 33 -

R^3 für Alkyl steht,

R^4 für Alkyl, Phenyl, Halogenalkylthio,
Alkoxycarbonyl oder Phenoxy carbonyl steht
oder

5 R^3 und R^4 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an
dem sie stehen, einen Saccharinrest bilden,

dadurch gekennzeichnet, daß man Saccharin der For-
mel (II)



(II)

10 mit Iso- bzw. Thioisocyanat-Derivaten der Formel (III)

XCN-R

(III)

in welcher

X und R die oben angegebene Bedeutung haben,

15 gegebenenfalls in Gegenwart eines Lösungs- oder
Verdünnungsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart
eines Katalysators umsetzt.

6. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch
einen Gehalt an mindestens einem acylierten Saccha-
rin-Derivat der Formel (I) gemäß den Ansprüchen
20 1 und 5.

Le A 23 286 Ausland

7. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, daß man acylierte Saccharin-Derivate der Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 und 5 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
- 5
8. Verwendung von acylierten Saccharin-Derivaten der Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 und 5 zur Bekämpfung von Schädlingen.
9. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmittern, dadurch gekennzeichnet, daß man acylierte Saccharin-Derivate der Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 und 5 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln mischt.
- 10
10. Verwendung von acylierten Saccharin-Derivaten gemäß Anspruch 8 zur Bekämpfung von Pilzen und Bakterien.
- 15

Le A 23 286 Ausland



Europäisches
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

0177740
Nummer der Anmeldung

EP 85 11 0995

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE

Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl. 4)		
A	GB-A-1 278 111 (NIHON NOHYAKU CO. LTD.) * Ansprüche 1, 2, 5; Seite 2, Zeile 52 - Seite 5 * & DE - A - 1 953 422 (Kat. D,A) ---	1,5,6, 8,10	C 07 D 275/06 A 01 N 47/38		
D,A	US-A-3 264 314 (J.W. BAKER et al.) * Anspruch 1; Spalte 1, Zeilen 30-72; Spalte 2, Zeilen 42-51 *	1,5,8, 10			
A	FR-A-2 507 599 (CHINOIN GYOGYSZER ES VEGYESZETI TERMEKEK GYARA RT) * Anspruch 1 *	1,5			
-----			RECHERCHIERTE SACHGEBiete (Int. Cl.4)		
			A 01 N 47/38 C 07 D 275/04 C 07 D 275/06		
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt.					
Recherchegort BERLIN	Abschlußdatum der Recherche 06-12-1985	Prüfer HASS C V F			
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : nichtschriftliche Offenbarung P : Zwischenliteratur T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze					
E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmelde datum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus andern Gründen angeführtes Dokument & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument					